

⑬ 日本国特許庁(JP)

⑭ 特許出願公開

⑮ 公開特許公報(A)

昭61-161219

⑯ Int.Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑰ 公開 昭和61年(1986)7月21日

A 61 K 35/78
7/00ADA
ABE7138-4C
7306-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑱ 発明の名称 アトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物

⑲ 特 願 昭60-1222

⑳ 出 願 昭60(1985)1月8日

㉑ 発 明 者 有 地 滋

豊中市寺内2丁目6番1号1002

㉒ 発 明 者 木 村 善 行

豊中市東寺内町173番608号 株式会社大阪薬品研究所内

㉓ 出 願 人 株式会社 大阪薬品研

豊中市東寺内町173番608号

究所

㉔ 代 理 人 弁理士 清原 義博

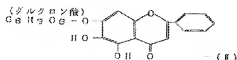
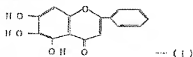
明 細 書

1. 発明の名称

アトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物

2. 特許請求の範囲

- (1) コガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物。
- (2) 煎製コガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)から抽出された抽出物が次式 (I) 及び／又は次式 (II) であることを特徴とするアトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物。



3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

この発明はアトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物に関し、より詳しくはこの発明の目的はシソ科(Labiatae)のコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORG.)から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎炎症用化粧料組成物の提供にある。

(発明の背景)

一般に、アレルギー反応とは、生体内で抗原抗体反応が起こるとその結果生体の化学伝達物質であるヒスタミン、アセチルコリン、ブラディキニン、SRS-Aなどが遊離されこれが組織を激害して起こる生体反応であると解されている。

このアレルギー反応の一種であるアトピー症とは、人間に特有な、一定の物質に対する先天的過敏症のことを言い、本人及び家族に気管支喘息、枯草熱、アレルギー性鼻炎として発症し、この原因は遺伝し、この家系の人は食物や吸収される抗

原に対し高度の過敏性を呈しやすいことなどの特徴があると言われている。

アトピー性皮膚炎とは、このような素因の上に生じる皮膚疾患であって、その自覚的な症状としては著明な痒痒感があり、経歴によって皮膚は増悪し慢性化すると言われている。またこのようなアトピー性皮膚炎の発症率は発作的に出現することが多く、かつ僅かな刺激によって誘発、増強される傾向があると言われている。

アトピー性皮膚炎はアレルギー反応の一様態であるので、その治療のためには前記アレルギー反応の箇因の一つであるSRSAの前駆物質である5-HETBの産出を阻害すればよく、この5-HETBはアラキドン酸のリボキシゲナーゼ代謝物の一つであるゆえ5-HETBを特異的(選択的)に阻害するものは抗アレルギー効果特にアトピー性皮膚炎の治療剤としての用途が極めて高いと考えられている。

(従来技術及びその欠点)

従来のこのようなアトピー性皮膚炎に対して

治療は、全身療法として抗ヒスタミン剤の内服、また、ヒスタミン阻害薬ドロブリン製剤、強力ノブフェゲンC、ノイロトロピン特号などの皮下注射が挙げられる。

しかしこれらはいずれも医薬品であるため処方及び治療にあたって医師の診断と指示を仰がなければならず、特に皮下注射は効果が大いといわれるが反面大きな痛みを伴うので乳幼児には適さないという欠点があった。

また、局所療法としてワセリン基剤の副腎皮質ホルモン軟膏などがあるが、乳児性軟膏基剤は適応範囲が狭く、ときには急性増悪をきたすこともあり、また副腎皮質ホルモン軟膏はその経皮吸収による内分泌系への影響があり、とくに乳幼児ではその影響が大いという欠点があった。

(発明の経緯)

そこでこの発明者は、上記従来の欠点を悉く解消するため前記したリボキシゲナーゼの特異的(選択的)な阻害剤の発見につとめたところ、従来は消炎、解熱剤としてしか知られていなかったコ

ガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種に關し既知研究したところ、何と驚くべきことにこのコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物がリボキシゲナーゼを特異的(選択的)に阻害し即ち5-HETBの産出を阻害することを見いだした。

その結果このコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてなる化粧料組成物を調製すればこの化粧料組成物がアトピー性皮膚炎の治療に大きな効果があることを見いだすことが発明に致った。

(解決手段)

即ちこの発明はコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてな

るアトピー性皮膚炎用化粧料組成物に係るものである。

(発明の構成)

この発明で使用するコガナバナとはシソ科(Labiata)に属する多年草で学名をスカテラリア バイカレンシス ゲオルギ (*Scutellaria baicalensis* GEORGI) といひ、原産は中国大陸に広く分布し朝鮮半島にまでおよぶものである。

この発明においては、このようなコガナバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)の同属のスカテラリア ヴェシシゲラ ユグダ (*Scutellaria vicioides* HUXGB.)、スカテラリア レーダリア ナ ディールス (*Scutellaria reideriana* DIELS.)、スカテラリア アモエナ ヴィグート (*Scutellaria amoenula* WIGHT)などの近縁種もまた好適に使用することができる。これらの全部位(地上部または地下部、あるいは種子)特に根を原材料として好適に使用できる。

この発明において、コガナバナの乾燥粉末を得るには、まずコガナバナを公知の天然乾燥、熱風

乾燥、あるいは凍結乾燥のいずれかの手段で乾燥させ、膠コガネバナ乾燥物を公知の環状粉末（ホーメル・スクリュー）によって粉末化する。この発明においてはこの粉末も必須配合成分として有効に利用される。

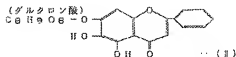
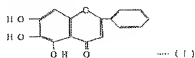
次いで上記コガネバナ乾燥粉末からその抽出物を以下のようにして得る。

まず、非酸強コガネバナを細切りし、この細切り物又は前記乾燥粉末を水またはメタノールで50℃、1～2hr加熱下で抽出し、濾過し、濾液を濃縮し、更に減圧濃縮して乾固する。この発明においてはこの濃縮液の段階でも必須配合成分として利用できると、又乾固物の段階でも配合成分とすることができる。

更に前記乾固物をメタノールに溶解すると沈着物と溶解物に、この乾固物が分かれる。この沈着物(1)をデカンテーションで取り出すとともに、メタノール溶液に塩化カルシウムを加え、これに密風で泡を加えて混濁操作を行ない、濃縮しこの濃縮物を使用するか又は更に減圧濃縮して沈着物

(2)を得、配合成分とすることができる。

この沈着物(1)がバイカレイン(baicalein)(式1)で、沈着物(2)がバイカリン(baicalein)(式2)である。



コガネバナの乾燥粉末及び/又は以上のようにして得られたそれぞれの段階のコガネバナの抽出物を使用してこの発明に係るアトピー性皮膚炎症用化粧品組成物とするには、通常使用量が一日に20mg乃至100mg程度のコガネバナ乾燥粉末及び/又はコガネバナ抽出物を使用できる様な任意の化粧品組成物形態とすればよい。

その形態例を具体的に示すと、軟膏、石鹸

化粧水、クリーム等が挙げられる。

(発明の効果)

以上の如くこの発明に係るコガネバナ(Scutellaria baicalensis G30821)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガネバナ(Scutellaria baicalensis G30821)から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎症用化粧品組成物は、軟膏、石鹸、化粧水、クリーム等の任意の化粧品組成物として使用すれば、医薬品でないで、治療にあたって医師の診断と指示を仰ぐ必要がなく、家庭で手軽に使用できるという効果を奏す。

また、軟膏、石鹸、化粧水、クリーム等の形態であるので皮下注射のような大きな痛みを伴わない故、乳幼児には特に適するという効果を奏す。

更に、化粧品組成物の配合組成中に含まれていゝ成分は植物抽出成分であるので、副腎皮質ホルモン軟膏のようにその経皮吸収による内分泌系への影響などの副作用が殆どないという効果を奏す。

以下この発明に係るアトピー性皮膚炎症用化粧品組成物の試験例を記載することにより、この発明の効果をより一層明確なものとす。

(試験例)

クイスター系グラットを使用し、このグラット塩酸内多核白血球をHGPS-生体濃縮液(pH 7.4)で洗浄し、同級濃縮液に懸濁、超音波処理を行なったものをアラキドン酸代謝の酵素液として用いた。この血が緩オモジネイトとバイカレイン(baicalein)及びバイカリン(baicalin)の浸漬にそれぞれ示す種々の濃度のサンプルとを37℃、5分間濃縮し、その後100℃アラキドン酸(0.05mg)を加える5分間インキュベイトする。反応をpHで止め(pH 3)アラキドン酸代謝産物を酢酸エチルで抽出し、シリカゲル薄層クロマトグラフィー(TLC)で分離して定置した(展開液：石油エーテル：エーテル：酢酸=50:50:1、V/V、TLCはメルツ574B)。放射活性物質はオートラジオグラフィで検出し、そのスポットを剪取り、放射活性を液体シンチレーションカウンターで定置した。

尚、次表に示す12-ハイドロキシヘプタデカトリエン酸(HHT)はシクロオキソゲナーゼにより代謝される5-ハイドロキシエイコサテトラエン酸(5-HETE)である。HHTは既知のHHTとの比較により同定した。5-HETEはGC-MSにより同定した。

以下、試験結果を第1乃至第2表にまとめて示す。

第 1 表

		生成物 (比較例との割合%)	
		HHT	5-HETE
* バイカレイン	**	100.0 ± 0.0	100.0 ± 0.0
	-7	94.0 ± 0.0	84.0 ± 0.0
	-6	90.0 ± 0.0	65.0 ± 4.0
	-5	89.0 ± 2.7	49.0 ± 0.0
	-4	30.0 ± 9.0	87.5 ± 4.5
	-3	10.0 ± 4.0	32.0 ± 4.0

* バイカレインの単位は1モル×10の誘導指数
** 濃度0の比較例

第 2 表

		生成物 (比較例との割合%)	
		HHT	5-HETE
* バイカレイン	**	100.0 ± 0.0	100.0 ± 0.0
	-7	95.5 ± 2.5	81.8 ± 4.7
	-6	91.5 ± 5.0	71.0 ± 1.5
	-5	92.8 ± 12.3	53.5 ± 5.0
	-4	22.8 ± 4.8	44.0 ± 5.0
	-3	16.5 ± 3.0	35.0 ± 5.0

* バイカレインの単位は1モル×10の誘導指数
** 濃度0の比較例

以上の結果明らかな如く、この発明で使用するバイカレイン (baicalin) 及び/又はバイカリン (baicalin) は5-HETEの産出を阻害するものとして優れた効果を奏し、即ちバイカレイン (baicalin) 及び/又はバイカリン (baicalin) を必須成分とする化粧品組成物はアレルギー皮膚の一種類であるアトピー性皮膚炎等の治療に優れた効果を奏することがわかる。

代理人 井理士 清 原 義 博



PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 61-161219

(43)Date of publication of application : 21.07.1986

(51)Int.Cl.

A61K 35/78

A61K 7/00

(21)Application number : 60-001222

(71)Applicant : OSAKA CHEM LAB

(22)Date of filing : 08.01.1985

(72)Inventor : YUCHI SHIGERU
KIMURA YOSHIYUKI

(54) SKIN COMPOSITION FOR ATOPIC DERMATITIS

(57)Abstract:

PURPOSE: The titled composition effective for atopic dermatitis, inhibiting specifically lipoxygenase and production of 5-HETE, comprising dried powder of 'KOGANEHANA' (*Scutellaria baicalensis* GEORGI) of the family Labiatae or its relative species, or an extract of the powder as an essential component.

CONSTITUTION: A composition comprising baicalein shown by the formula I or baicalein shown by the formula II of dried powder of 'KOGANEHANA' (*Scutellaria baicalensis* GEORGI) or its relative species (e.g., *Scutellaria viscidula* BUXGE, etc.) or an extract of the powder as an active ingredient. This composition can be used any cosmetic composition (e.g., ointment, soap, toilet lotion, cream, etc.), and easily applied at home without indication of doctor. It has no side effect like adrenocortical hormone ointment, inhibits production of 5-HETE, and has improved remedying effect on atopic dermatitis, one form of allergic reactions.

